

**2003年11月改訂(第5版)D2
*2002年3月改訂

指定医薬品



抗真菌剤(錠剤)
オキナゾール[®]V100
オキナゾール[®]V600
硝酸オキシコナゾール錠
OKINAZOLE V100, V600

貯 法：遮光保存，室温保存
使用期限：外箱に表示の使用期限内に使用すること

	オキナゾールV100	オキナゾールV600
承認番号	(02AM)0950	(02AM)0951
薬価収載	1990年11月	1990年11月
販売開始	1990年11月	1990年11月
再審査結果	1998年3月	

【禁忌】 次の患者には使用しないこと)
本剤及び他の硝酸オキシコナゾール製剤に過敏な患者

****【組成・性状】**

	オキナゾールV100	オキナゾールV600
有効成分 (1錠中)	硝酸オキシコナゾール 100mg	硝酸オキシコナゾール 600mg
添加物	乳糖，セルロース，ヒドロキシプロピルセルロース，クエン酸，ステアリン酸Mg	セルロース，ヒドロキシプロピルセルロース，クエン酸，ステアリン酸Mg
性状・剤形	白色・においなし・アーモンド形の素錠	
外形		
規格	長径 短径 厚さ 重量 (mm) X (mm) X (mm) (g) 20 12 約5.8 1.2	長径 短径 厚さ 重量 (mm) X (mm) X (mm) (g) 20 12 約5.7 1.2
識別コード	Ⓔ 268	Ⓔ 269

【効能・効果】

カンジダに起因する膣炎及び外陰膣炎

【用法・用量】

オキナゾール V100	1日1回1錠を膣深部に挿入し，6日間継続使用する。 なお，真菌学的効果(一次効果)が得られない場合は，オキナゾールV100を更に1日1回1錠6日間継続使用する。
オキナゾール V600	1週1回1錠を膣深部に挿入する。 なお，真菌学的効果(一次効果)が得られない場合は，オキナゾールV600を更に1回1錠使用する。

【使用上の注意】

1. 副作用

* 総症例数6,995例中26例(0.37%)36件の副作用が報告されている。主な副作用は局所の発赤8件(0.11%)，刺激感6件(0.09%)，ひりひり感3件(0.04%)，痒痒感3件(0.04%)，疼痛3件(0.04%)等であった。(再審査終了時)

種類	頻度	0.1~5%未満	0.1%未満
過敏症 ^{注)}			発疹等
膣・外陰	発赤		刺激感，ひりひり感，痒痒感，疼痛等

注)このような場合には，使用を中止すること。

2. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与

妊娠12週未満の妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には，治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ使用すること。(安全性は確立していない。)

3. 適用上の注意

使用部位：
膣にのみ使用し，経口投与しないこと。

【薬物動態】

1. 血漿中濃度¹⁾

外陰膣カンジダ症患者10名に硝酸オキシコナゾール100mg錠を1日1回1錠6日間，また，9名に硝酸オキシコナゾール600mg錠を1回1錠膣内投与したときの血漿中濃度は6.1~36ng/mLの範囲を示し，おおむね25ng/mL以下であった。

健常婦人6名に硝酸オキシコナゾール100mg錠を1日1回1錠6日間及び硝酸オキシコナゾール600mg錠を1回1錠膣内投与したときの血漿中濃度は，検出されないか，検出された場合でも20ng/mL以下であった。

2. 参考 動物における分布，排泄

分布：¹⁴C-硝酸オキシコナゾール5mg/kgをラット(n=3)に膣内投与した時の組織内濃度は，血漿中濃度に比べて副腎，卵巣，肝，小腸，腎及び脂肪では高く，大脳，小脳，胸腺，骨格筋，羊水では低かった。投与後の組織内濃度は血漿中濃度と同様に推移し，特定の組織に残留する傾向はみられなかった。また，同様に妊娠ラットに膣内投与した時の胎児の組織内濃度は母獣の血漿中濃度とほぼ同程度であった。

排泄：¹⁴C-硝酸オキシコナゾール5mg/kgをラット(n=3)に膣内投与したとき，投与後336時間までに尿中に8.1%及び糞中に36.5%が排泄された。

【臨床成績】

二重盲検比較試験を含む臨床試験の評価対象537例における有効以上の有効率は次のとおりであった²⁻⁹⁾。

オキナゾールV100：有効率(1週)89.5%
(231例/258例)
オキナゾールV600：有効率(1週)88.5%
(247例/279例)

【薬効薬理】

1. 抗真菌作用¹⁰⁾

硝酸オキシコナゾールは酵母状真菌，二形性真菌(臨床分離株)等に対して広範囲な抗菌スペクトルを有し，そのMICは10µg/mL以下であった。

菌 種	MIC(µg/mL)
<i>Candida albicans</i>	< 0.04 ~ 10
<i>Candida glabrata</i>	< 0.04 ~ 0.16

培地：Sabouraud dextrose agar

2. 作用機序^{10,11)}

硝酸オキシコナゾールの抗真菌活性は、直接的細胞膜障害作用により発揮される。また、低濃度域での部分的発育阻止効果には、エルゴステロール合成阻害作用が関与している。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：硝酸オキシコナゾール, Oxiconazole Nitrate(JAN)

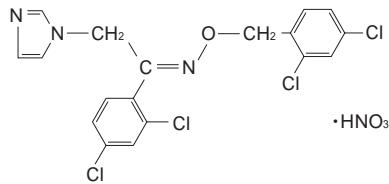
化学名：2', 4'-Dichloro-2-imidazol-1-ylacetophenone(Z)

[O-(2, 4-dichlorobenzyl)oxime]mononitrate

分子式：C₁₆H₁₃Cl₄N₃O · HNO₃

分子量：492.14

構造式：



性状：白色～微黄白色の結晶又は結晶性の粉末で、わずかに特異なおいがある。N,N-ジメチルホルムアミドに溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、エタノール(95)、無水酢酸又は酢酸(100)にやや溶けにくく、水に極めて溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

融点：約142 (分解)

【包装】

オキシコナゾールV100 120錠(6錠×20)

オキシコナゾールV600 30錠(6錠×5)

【主要文献及び文献請求先】

1. 主要文献

- 1) 高田道夫 他：産婦人科の世界, 41, 471(1989)
- 2) 水野重光 他：産婦人科の世界, 41, 253(1989)
- 3) 林 博章 他：基礎と臨床, 23, 2863(1989)
- 4) 三輪 是 他：基礎と臨床, 23, 2871(1989)
- 5) 松原穰介 他：薬理と治療, 17, 2949(1989)
- 6) 曾我賢次 他：基礎と臨床, 23, 3309(1989)
- 7) 辰田一郎 他：薬理と治療, 17, 2959(1989)
- 8) 内藤博之 他：薬理と治療, 17, 3643(1989)
- 9) 松井和夫 他：基礎と臨床, 23, 3320(1989)
- 10) 平谷民雄 他：CHEMOTHERAPY, 32, 568(1984)
- 11) 平谷民雄 他：CHEMOTHERAPY, 33, 215(1985)

** 2. 文献請求先

三菱ウェルファーマ株式会社 製品情報部

〒541-0047 大阪市中央区淡路町2-5-6

電話 0120-189-707